

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 8 月 11 日 (11.08.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/073180 A1

(51) 国際特許分類: C07C 259/06, C07D 209/22, 209/24, 211/58, 213/40, 235/16, 295/18, 401/04, 405/04, A23L 1/30, A61K 7/00, 31/164, 31/165, 31/167, 31/17, 31/18, 31/275, 31/405, 31/4184, 31/4402, 31/4453, 31/4468, 31/454, A61P 1/16, 3/10, 7/02, 9/10, 13/12, 19/02, 19/08, 19/10, 25/00, 25/28, 27/10, 27/12, 29/00, 37/00, 43/00

英之 (YAMATO, Hideyuki) [JP/JP]; 〒1210813 東京都足立区竹の塚五丁目 2 4 番 2 1 号 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 石川 徹 (ISHIKAWA, Toru); 〒2290033 神奈川県相模原市緑沼台二丁目 2 4 番 1 2 号 藤ビル 2 階 オリオン国際特許事務所 Kanagawa (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/019512

(22) 国際出願日: 2004 年 12 月 27 日 (27.12.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2003-428901
2003 年 12 月 25 日 (25.12.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 呉羽化学工業株式会社 (KUREHA CHEMICAL INDUSTRY COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1038552 東京都中央区日本橋堀留町一丁目 9 番 1 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 角地 淳二 (KAKUCHI, Junji) [JP/JP]; 〒1820001 東京都調布市緑ヶ丘二丁目 3 8 番 3 2 号 Tokyo (JP). 山崎 徹 (YAMAZAKI, Toru) [JP/JP]; 〒1240022 東京都葛飾区奥戸九丁目 2 2 番 1 1 号 Tokyo (JP). 小原 かず美 (OBARA, Kazumi) [JP/JP]; 〒2700127 千葉県流山市富士見台二丁目 5 番 8-2-5 0 2 号 Chiba (JP). 大和

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

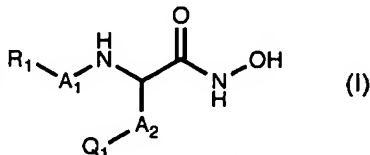
添付公開書類:

— 国際調査報告書
— 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: HYDROXAMIC ACID DERIVATIVE AND AGE GENERATION INHIBITOR CONTAINING THE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: ヒドロキサム酸誘導体、及び該誘導体を含む AGE 生成阻害剤



(57) Abstract: [PROBLEMS] To provide a novel compound which inhibits the generation of AGE and an AGE generation inhibitor containing the compound. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] The compound is one represented by the following formula or a pharmaceutically acceptable salt thereof. Also provided are a medicinal composition containing the compound or salt and an additive composition containing the compound.

(57) 要約: (課題) AGE 生成阻害を有する新規な化合物、及び該化合物を含む AGE 生成阻害剤を提供する。(解決手段) 下記式で表される化合物、その医薬として許容し得る塩、これらを含む医薬組成物、及び該化合物を含む添加剤組成物。【化 2 1】

WO 2005/073180 A1

又はCHを表し、 Y_3 は単結合、 $-CO-$ 、又は $-SO_2-$ を表し、

Q_4 は任意の場所が置換していても良い、3～10員の炭化水素、又はそれぞれ1～3個の窒素原子、酸素原子、又は硫黄原子を含む環状化合物を表し、

(但し、 R_1 が水素原子であり、 A_1 が単結合であり、 A_2 がメチレン若しくはエチレンであり、 Q_1 が Q_2 であり、 R_5 が $Y_2-A_3-R_2$ であり、 Y_2 が酸素原子であり、 A_3 がメチレンであり、かつ R_2 がフェニルである場合、

R_1 が水素原子であり、 A_1 が単結合であり、 A_2 がメチレンであり、 Q_1 が $Y_1-A_3-R_2$ であり、 Y_1 がSであり、かつ A_3 がエチレンである場合、

R_1 が水素原子であり、 A_1 が単結合であり、 A_2 がエチレンであり、 Q_1 が $Y_1-A_3-R_2$ であり、 Y_1 がSであり、 A_3 が単結合であり、かつ R_2 がエチルである場合、

及び、 A_2 がメチレンであり、 Q_1 が $-Y_1-A_3-R_2$ を示し、 Y_1 が NR_3CO であり、 A_3 がエチレンであり、かつ R_2 がフェニルである場合を除く。)

[2]

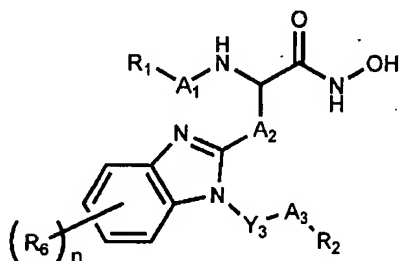
下記式(III)の化合物

[化14]

(Uses)

(preparation of hydroxamic acid derivs. as AGE generation inhibitors)

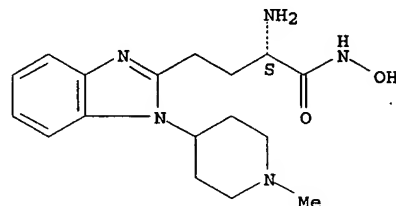
862400-22-4 CAPLUS

1H-Benzimidazole-2-butanamide, α -amino-N-hydroxy-1-(1-methyl-4-piperidiny)-, (α S)-, trifluoroacetate (salt) (9CI) (CA INDEX NAME)

(III)

CRN 862400-21-3
CMF C17 H25 N5 O2

Absolute stereochemistry.



式(III)中において、 R_1 は水素原子、炭素原子数1から10のアルキル基、炭素原子数2～10のアルケニル基、アリール基、ヘテロアリール基、又は飽和複素環基を表し、

A_1 及び A_2 はそれぞれ独立に単結合、又は炭素原子数1から6のアルキレン基を表し、

R_6 はそれぞれ独立に環上の任意の炭素原子に置換されていてもよく、それぞれ独立にハロゲン、アルキル基、ニトロ基、シアノ基、 $-OR_7$ 、 $-COOR_7$ 、又は $-CONR_7R$